PATENT COOPERATION TREATY

To:

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTICE INFORMING THE APPLICANT OF THE COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL APPLICATION TO THE DESIGNATED OFFICES

(PCT Rule 47.1(c), first sentence)

KUTZENBERGER, Helga Kutzenberger & Wolff Theodor-Heuss-Ring 23 50668 Köln

ALLEMAGNE

- 6. FE8. 2003

IMPORTANT NOTICE

Sw

Date of mailing(day/month/year) 16 January 2003 (16.01.03)

Applicant's or agent's file reference

International application No.

PCT/EP02/007380

GRA3025PCT

International filing date(day/month/year)
03 July 2002 (03.07.02)

Priority date(day/month/year)
05 July 2001 (05.07.01)

Applicant

GRÜNENTHAL GMBH, et al

1. Notice is hereby given that the International Bureau has communicated, as provided in Article 20, the international application to the following designated Offices on the date indicated above as the date of mailing of this notice:

KP, KR, US

In accordance with Rule 47.1(c), third sentence, those Offices will accept the present notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s).

2. The following designated Offices have waived the requirement for such a communication at this time:

AE, AG, AL, AM, AP, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EA, EC, EE, EP, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OA, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW

The communication will be made to those Offices only upon their request. Furthermore, those Offices do not require the applicant to furnish a copy of the international application (Rule 49.1(a-bis)).

- Enclosed with this notice is a copy of the international application as published by the International Bureau on 16 January 2003 (16.01.03) under No. WO 03/004483.
- 4. TIME LIMITS for filing a demand for international preliminary examination and for entry into the national phase

The applicable time limit for entering the national phase will, subject to what is said in the following paragraph, be 30 MONTHS from the priority date, not only in respect of any elected Office if a demand for international preliminary examination is filed before the expiration of 19 months from the priority date, but also in respect of any designated Office, in the absence of filing of such demand, where Article 22(1) as modified with effect from 1 April 2002 applies in respect of that designated Office. For further details, see *PCT Gazette* No. 44/2001 of 1 November 2001, pages 19926, 19932 and 19934, as well as the *PCT Newsletter*, October and November 2001 and February 2002 issues.

In practice, time limits other than the 30-month time limit will continue to apply, for various periods of time, in respect of certain designated or elected Offices. For regular updates on the applicable time limits (20, 21, 30 or 31 months, or other time limit), Office by Office, refer to the PCT Gazette, the PCT Newsletter and the PCT Applicant's Guide, Volume II, National Chapters, all available from WIPO's Internet site, at http://www.wipo.int/pct/en/index.html.

For filing a demand for international preliminary examination, see the PCT Applicant's Guide, Volume I/A, Chapter IX. Only an applicant who is a national or resident of a PCT Contracting State which is bound by Chapter II has the right to file a demand for international preliminary examination (at present, all PCT Contracting States are bound by Chapter II).

It is the applicant's sole responsibility to monitor all these time limits.

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Authorized officer

Judith Zahra

Facsimile No.(41-22) 740.14.35

Telephone No.(41-22) 338.91.11

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION CONCERNING SUBMISSION OR TRANSMITTAL OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

KUTZENBERGER, Helga Kutzenberger & Wolff Theodor-Heuss-Ring 23 50668 Köln

Germany

- 5. DEZ. 2002

Date of mailing (day/month/year)

11 November 2002 (11.11.02)

Applicant's or agent's file reference
GRA3025PCT

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.
PCT/EP02/07380

International filing date (day/month/year)
O3 July 2002 (03.07.02)

International publication date (day/month/year)
Not yet published

Priority date (day/month/year)
O5 July 2001 (05.07.01)

Applicant

GRÜNENTHAL GMBH et al

- 1. The applicant is hereby notified of the date of receipt (except where the letters "NR" appear in the right-hand column) by the International Bureau of the priority document(s) relating to the earlier application(s) indicated below. Unless otherwise indicated by an asterisk appearing next to a date of receipt, or by the letters "NR", in the right-hand column, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
- 2. This updates and replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents.
- 3. An asterisk(*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b). In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
- 4. The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which was not received by the International Bureau or which the applicant did not request the receiving Office to prepare and transmit to the International Bureau, as provided by Rule 17.1(a) or (b), respectively. In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority date
Priority application No.
Country or regional Office
Or PCT receiving Office
Of priority document

1.1. 2001 (05.07.01)

1.1. 2001 (05.07.01)

05 July 2001 (05.07.01) 101 32 725.0

DE

05 Augu 2002 (05.08.02)

The Int rnational Bureau of WIPO 34, chemin d s C I mbettes 1211 Geneva 20, Switzerland Authorized officer

Pierrot CREPPY

Telephone No. (41-22) 338.83.38

Form PCT/IB/304 (July 1998)

Facsimile No. (41-22) 740.14.35

005254181

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	WEITERES siehe Mitteilung	über die Übermittlung des internationalen					
GRA3025PCT	Recherchenberio	chts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit stehender Punkt 5					
Internationales Aktenzeichen	Internationales Anmeldedatum	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)					
	(Tag/Monat/Jahr)						
PCT/EP 02/07380	03/07/2002	05/07/2001					
Anmelder	Anmelder						
GRÜNENTHAL GMBH		<u> </u>					
Dieser internationale Recherchenbericht wurdertikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem In		örde erstellt und wird dem Anmelder gemäß					
Dieser internationale Recherchenbericht umf X Darüber hinaus liegt ihm je		r. annten Unterlagen zum Stand der Technik bei.					
Grundlage des Berichts							
	ernationale Récherche auf der Grundlage d gereicht wurde, sofern unter diesem Punkt	er internationalen Anmeldung in der Sprache nichts anderes angegeben ist.					
Die internationale Rechercl Anmeldung (Regel 23.1 b))		rde eingereichten Übersetzung der internationalen					
Recherche auf der Grundlage des	Sequenzprotokolls durchgeführt worden, da	I/oder Aminosāuresequenz ist die internationale as					
	eldung in Schrifticher Form enthalten ist.	an atamaiataka wandan tak					
	ionalen Anmeldung in computerlesbarer Fo						
	ch in schriftlicher Form eingereicht worden ch in computerlesbarer Form eingereicht w	•					
Die Erklärung, daß das nac	chträglich eingereichte schriftliche Sequenz	protokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der					
	im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde von	orgeiegt. nen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen,					
wurde vorgelegt.	omputenessaler ronn enasten information						
2. Bestimmte Ansprüche ha	ben sich als nicht recherchierbar erwie	sen (siehe Feld I).					
3. MangeInde Einheitlichkei	t der Erfindung (siehe Feld II).	•					
4. Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfi	ndung						
wird der vom Anmelder ein	gereichte Wortlaut genehmigt.						
X wurde der Wortlaut von de	r Behörde wie folgt festgesetzt:						
SUBSTITUIERTE Y-LACTON	VERBINDUNGEN ALS NMDA-ANTA	AGONISTEN					
5. Hinsichtlich der Zusammenfassung							
wurde der Wortlaut nach F	igereichte Wortlaut genehmigt. legel 38.2b) in der in Feld III angegebenen de innerhalb eines Monats nach dem Datun Stellungnahme vorlegen.	Fassung von der Behörde festgesetzt. Der n der Absendung dieses internationalen					
6. Folgende Abbildung der Zeichnungen	ist mit der Zusammenfassung zu veröffen						
wie vom Anmelder vorgesc	chlagen	X keine der Abb.					
	eine Abbildung vorgeschlagen hat.						
weil diese Abbildung die E	rfindung besser kennzeichnet.						

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/07380

Feld III

WORTLAUT DER ZUSAMMENFASSUNG (F rtsetzung von Punkt 5 auf Blatt 1)

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte γ -Lactonverbindungen, Verfahren zu deren Herstellung, Arzneimittel enthaltend diese Verbindungen sowie die Verwendung dieser Verbindungen zur Herstellung von Arzneimitteln.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 02/07380

A. KLASSII	FIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES C07D307/32 C07D405/12 A61K31/3					
IPK 7	C070307/32 C07D405/12 A61K31/3	41 A61P23/00	·			
			,			
Nach der Int	ernationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klas	sifikation und der tPK				
B. RECHER	RCHIERTE GEBIETE					
.	ter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbo	fe)				
IPK 7	C07D	•	•			
Recherchier	te aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, so	weit diese unter die recherchierten Gebiete	fallen			
,	·					
Während de	r internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (N	ame der Datenbank und evtl. verwendete S	Suchbeariffe)			
	BS Data, EPO-Internal	•				
CITEM A	bo baca, Elo Incernar		•			
		·				
C. ALS WE	SENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN					
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erfordertich unter Angabe	e der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.			
x /	✓GONZALEZ, DAVID ET AL: "Chemoenz	ymic	1,3,4			
	Synthesis of Unnatural Amino Acid					
	Modified Claisen Rearrangement of					
	Enolates. Approach to Morphine Sy JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY (199					
	62(5), 1194-1195 ,	,,,	·			
	XP001097342					
	Seite 1195					
$\left[\mathbf{x}^{'} \right]$			1 2 4			
	<pre>PLUSQUELLEC, DANIEL: "Friede1-Cr reactions of.gammaary1gamma</pre>		1,3,4			
	J. CHEM. RES., SYNOP. (1982), (2)					
	XP001097650	,				
	Seite 46					
		,				
		-/				
			•			
	,					
	tere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu ehmen	Siehe Anhang Patentfamilie				
	The state of the s	*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem				
	A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist					
	'E' älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist YV Veriffentlicht worden ist					
'L' Veröffe	*L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft er- kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf					
scheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden vv Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie						
ausgeführt) Kann nicht als auf errinderscher Laitgkeit Derunden betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen						
	führt)	werden, wenn die Veröffentlichung mit	einer oder mehreren anderen			
O Veröffe eine E	führt) entlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht	kann nicht als auf erfinderischer Tatigi	einer oder mehreren anderen Verbindung gebracht wird und			
O Veröffe eine E *P* Veröffe	führt) entlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, senutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht mitlichung die vor dem internationalen. Anmektedatum, aber nach	werden, wenn die Veröffentlichung mit Veröffentlichungen dieser Kategorie in	eit berunend betrachtet einer oder mehreren anderen Verbindung gebracht wird und naheliegend ist			
O Veröffe eine B *P* Veröffe dem b	führt) entlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht entlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach	kann nicht als auf erfinderischer Laigh werden, wenn die Veröffentlichung mit Veröffentlichungen dieser Kategorie in diese Verbindung für einen Fachmann	tent berunend betrachtet einer oder mehreren anderen Verbindung gebracht wird und naheliegend ist Patentfamilie ist			
O Veröffe eine B *P* Veröffe dem b	führt) entlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, senutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht entlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach eanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist Abschlusses der internationalen Recherche	kann nicht als auf erfinderischer Latigh werden, wenn die Veröffentlichung mit Veröffentlichungen dieser Kategorie in diese Verbindung für einen Fachmann *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselber Absendedatum des internationalen Re	tett berunend betrachtet einer oder mehreren anderen Verbindung gebracht wird und naheliegend ist Patentfamilie ist			
O Veröffe eine B *P* Veröffe dem b	führt) entlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht entlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach Beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist	kann nicht als auf erfinderischer Laigh werden, wenn die Veröffentlichung mit Veröffentlichungen dieser Kategorie in diese Verbindung für einen Fachmann *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselber	tett berunend betrachtet einer oder mehreren anderen Verbindung gebracht wird und naheliegend ist Patentfamilie ist			
O Veröffe eine E *P* Veröffe dem b Datum des	führt) entlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, senutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht entlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach eanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist Abschlusses der internationalen Recherche	kann nicht als auf erfinderischer Latigh werden, wenn die Veröffentlichung mit Veröffentlichungen dieser Kategorie in diese Verbindung für einen Fachmann *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselber Absendedatum des internationalen Re	tett berunend betrachtet einer oder mehreren anderen Verbindung gebracht wird und naheliegend ist Patentfamilie ist			

2

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 02/07380

		101/21	J2/0/380
C.(Fortsetz	ung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		·
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht komm	enden Teile	Betr. Anspruch Nr.
x J	✓PLUSQUELLEC, DANIEL ET AL: "Reactions of glyoxylic acid derivatives with olefins: syntheses of.alpha.—substituted.gamma.—lactones" BULL. SOC. CHIM. FR. (1979), (9-10, PT. 2), 552-8, XP001097998 Seite 553 Seite 556		1,3,4
X	BEN-ISHAI, D. ET AL: "A new synthesis of amino acids. II. Amidoalkylation of olefins with glyoxylic acid derivatives" TETRAHEDRON (1977), 33(12), 1533-42, XP001095785 Beispiel 8C		1,3,4
X	ALTMAN, JANINA ET AL: "Amino acid synthesis. II. Amidoalkylation of olefins with glyoxylic aci derivatives" TETRAHEDRON LETT. (1975), (43), 3737-40, XP001097977 Seite 3738	5	, 3,4
A /	FOSCOLOS G B ET AL: "SYNTHESIS AND PHARMACOLOGICAL STUDY OF SOME NEW BETA-(DIALKYLAMINOMETHYL)-GAMMA-BUTYROLACT ONES AND THEIR TETRAHYDROFURAN ANALOGUES" FARMACO, SOCIETA CHIMICA ITALIANA, PAVIA, IT, Bd. 1, Nr. 51, 1996, Seiten 19-26, XP000915050 ISSN: 0014-827X das ganze Dokument		-37

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts GRA3025PCT				WEITERES VOR	SEHEN	siehe Mitteilun vorläufigen Pri	g über die Übersendung Ifungsberichts (Formbla	g des internationaler att PCT/IPEA/416)
Internationales Aktenzeichen PCT/EP02/07380		Internationales Anmeld 03.07.2002	ledatum (Tag/Monat/Jahr)	Prioritätsdatum (Tag/ 05.07.2001	Monat/Jahr)		
	nationa D307		tentklassifikation (IPK) oder	nationale Klassifikation (ind IPK			
Anme GRÜ		NTHA	AL GMBH et al.					
1.	Dies beau	er int uftrag	ernationale vorläufige Pr ten Behörde erstellt und	üfungsbericht wurde v wird dem Anmelder ge	on der m emäß Art	iit der internatio ikel 36 übermit	onalen vorläufigen Pr telt.	üfung
2.	Dies	er BE	ERICHT umfaßt insgesar	nt 5 Blätter einschließ	lich diese	es Deckblatts.		
		und	erdem liegen dem Beric loder Zeichnungen, die g örde vorgenommenen B -).	eändert wurden und d	iesem Be	ericht zugrunde	liegen, und/oder Blä	tter mit vor dieser
	Dies	e Anl	agen umfassen insgesar	mt Blätter.				
3.	Dies	or Po	right anthält Angahan zu	i folgondon Dunidoni				-
J.			richt enthält Angaben zu					
	I.	Ø	Grundlage des Besche	eids				
			Priorität	Cutachtona Shanklaul	h		hadden and many of 1851	
	IV		Keine Erstellung eines		neit, emin	iderische Latig	keit una gewerbliche	Anwendbarkeit
	V	⊠	Mangelnde Einheitlichk Begründete Feststellur gewerblichen Anwendt	ng nach Regel 66.2 a)ii	i) hinsich I Erkläru	tlich der Neuhe ngen zur Stützi	eit, der erfinderischen ung dieser Feststellu	ı Tätigkeit und dei na
	VI		Bestimmte angeführte	Unterlagen		_	_	
	VII		Bestimmte Mängel der	internationalen Anmel	dung			
	VIII		Bestimmte Bemerkung	en zur internationalen	Anmeldu	ıng		
Datun	n der	Einrei	chung des Antrags		Datum	der Fertigstellung	dieses Berichts	
10.0	9.200	02			05.11.	2003		
	und l	n Beh		onalen Prüfung	Bevolin	nächtigter Bedien	steter	ESP ISONES PAYORISM
	lis.	D-8	ropäisches Patentamt 30298 München		Grass	i. D		
Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465			66 epmu d				\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	
					Tel. +48	89 2399-8499		73 DUG - 1035

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP02/07380

 Grundlage des B 	erichts
-------------------------------------	---------

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)):

	Bes	schreibung, Seiten						
	1-4	1	in der ursprünglich eingereichten Fassung					
	Ans	sprüche, Nr.						
	1-3	7	in der ursprünglich eingereichten Fassung					
	Zei	chnungen, Blätter						
	1/2,	2/2	in der ursprünglich eingereichten Fassung					
 Hinsichtlich der Sprache: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Spradie internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereic unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist. 								
	Die eing	Bestandteile stander gereicht; dabei hande	n der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache elt es sich um					
		die Sprache der Übe Regel 23.1(b)).	ersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach					
		die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).						
		die Sprache der Übe worden ist (nach Re	ersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht gel 55.2 und/oder 55.3).					
3.	Hin: inte	sichtlich der in der int rnationale vorläufige	ernationalen Anmeldung offenbarten Nucleotid- und/oder Aminosäuresequ nz ist die Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:					
in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.								
		zusammen mit der in	nternationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.					
		bei der Behörde nach	hträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.					
		bei der Behörde nac	hträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.					
		Die Erklärung, daß o Offenbarungsgehalt	das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.					
		Die Erklärung, daß o Sequenzprotokoll er	die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen ntsprechen, wurde vorgelegt.					
4.	Aufg	grund der Änderunge	n sind folgende Unterlagen fortgefallen:					
		Beschreibung,	Seiten:					
		Ansprüche,	Nr.:					
		Zeichnungen,	Blatt:					

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP02/07380

5. Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

- 6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:
- V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- 1. Feststellung

Neuheit (N)

Ja: Ansprüche 2,5-37

Nein: Ansprüche 1,3,4

Erfinderische Tätigkeit (IS)

Ja: Ansprüche 2,5

Nein: Ansprüche 1,3,4,6-37

Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)

a: Ansprüche: 1-37

Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

1) In diesem Bescheid werden die folgenden Dokumente (D) genannt:

D2: J. Chem. Res., Synop. (1982), (2), 46-7

D3: Bull. Soc. Chim. Fr. (1979), (9-10, Pt. 2), 552-8

D4: Tetrahedron (1977), 33(12), 1533-42

D5: Tetrahedron Lett. (1975), (43), 3737-40

D6: Farmaco, Societa Chimica Italiana, Pavia, It (1996), 1(51), 19-26

- 2) Die Anmeldung erfüllt nicht die Erfordernisse des Artikels 6 PCT, weil der Anspruch 1 nicht klar ist. Die Formel I gemäß Anspruch 1 umfaßt keine Verbindungen mit R1 = Tosyl, daher können solche Verbindungen auch nicht explizit ausgenommen werden.
- 3) Der Gegenstand der Ansprüche 1, 3 und 4 ist nicht neu (Artikel 33(2) PCT).
- 3.1) Die Verbindung 1.3b aus D2 fällt unter Anspruch 1 (R1 ist ein Phenyl- und Oxosubstituierter aliphatischer C1-Rest).
- 3.2) Die Verbindungen Benzamido-2 phényl-4 butanolide-4,

Benzamido-2 (méthyl-4' phényl)-4 butanolide-4,

Benzamido-2 (méthyl-3' phényl)-4 butanolide-4, und

Benzamido-2 (chloro-4' phényl)-4 butanolide-4,

aus D3 (vgl. Seite 556, linke Spalte) sind neuheitsschädlich (R1 ist ein Aryl- und Oxo-substituierter aliphatischer C1-Rest).

- 3.3) Die Verbindung 8c aus D4 (vgl. Seite 1534) ist neuheitsschädlich (R1 ist ein Phenyl- und Oxo-substituierter aliphatischer C1-Rest).
- 3.4) Die Verbindungen 9 aus D5 (vgl. Seite 3738) ist neuheitsschädlich (R1 ist ein Phenyl- und Oxo-substituierter aliphatischer C1-Rest).
- 4) Der neue Teil der Ansprüche 1, 3 und 4 beruht nicht auf einer erfinderischen Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT).

Als nächstliegender Stand der Technik wird D6 angesehen, welches die Verbindungen 6 und 7 im Zusammenhang mit der Aktivierung von NMDA Rezeptoren offenbart (vgl. Einleitung).

Als technische Aufgabe der vorliegenden Anmeldung wird die Bereitstellung von NMDA Antagonisten gesehen.

Die beanspruchten Verbindungen werden durch D6 nicht nahegelegt doch kann anhand der vorliegenden Daten nicht beurteilt werden, ob die Aufgabe gelöst worden ist.

Alle Beispiele weisen als Rest R1 eine Aryl- oder Heteroaryl- Gruppe auf, wovon die tatsächlich getesteten Verbindungen alle einen 3,5- Dichlorphenyl-Rest aufweisen. Mit Blick auf die große strukturelle Verwandtschaft der getesteten Verbindungen scheint es zweifelhaft, daß im wesentlichen alle beanspruchten Verbindungen (zum Beispiel Verbindungen in denen R1 einen über eine Alkylengruppe gebundenen Aryl/Heteroarylrest, einen aliphatischen Rest oder einen cycloaliphatischen Rest darstellt) die Aufgabe lösen.

Außerdem scheint die Anzahl und Art der Substituenten unbeschränkt zu sein. Solche offenen Definitionen ohne Angabe der Natur der Substituenten können in der Regel nicht zugelassen werden. Selbst wenn eine grosse Anzahl Verbindungen getestet werden sollte, kann nicht gezeigt werden, daß alle theoretisch möglichen Verbindungen das Problem lösen

5) Um die Erfordernisse der Regel 5.1 a) ii) PCT zu erfüllen, ist in der Beschreibung das Dokument D1 zu nennen, welches zur Maßgabe in Anspruch 1 Anlass gab.